

C₁ のアルキル基を表す。）、またはヒドロキシル基を表し、R₁ および R₂ がそれぞれ独立して、水素原子、C₁ ～C₄ のアルコキシ基、C₁ ～C₄ のアルキル基、-N(R₁R₂)₂ (R₁ および R₂ は C₁ ～C₄ のアルキル基を表す。)、またはヒドロキシル基を表し、YがC₁ ～C₄ のアルキル基、空素原子を 1 ～4 個含有する脱脂子数 5 ～ ∞ の極端環状基または C₁ ～C₄ のアリール基（アリール基はヒドロキシル基、C₁ ～C₄ のアルキル基、C₁ ～C₄ のアルコキシ基およびハログン原子からなる群から選ばれる 1 以上の固接基で置換されていてよい。）を表し、k が 0 ～ 3 の整数を表し、1 が 2 ～ 4 の整数を表す化合物が挙げられる。

では、ピロリル基、イミダゾリル基、ピラソリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジン基、ピラジニル基、ピロジニル基、ピロニル基、イミダゾリジニル基、ニル基¹⁰、イミダゾリニル基、ピラソリジニル基、ピラソニル基、ピリジニル基等が挙げられる。またヒドロキシル基、C₁～C₆のアルキル基、C₁～C₆のアルコキシ基およびハロゲン原子からなる群から選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₁～C₆のアリール基としては、フェニル基、メチルフェニル基、メトキシフェニル基、ヒドロキシルフェニル基、フロモフェニル基、クロロフェニル基、ブロモフェニル基、トリル基、ナフチル基等が挙げられる。

[0012] また本発明の別の態様によれば、上記ウレ

及、安息香酸、トルエンスルホン酸、メタンスルホン酸等の有機酸等と塩を形成することもできる。さらに本発明化合物またはその塩は、水和物ならびに消脱水化合物を形成することもできる。本発明の一般式(1)で表される

[0015]
化合物の具体例を下記表-1に示す。

(表1)

表-1

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	I
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	F-	1	2
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	Cl-	1	2
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	OC ₂ H ₅ -	1	2
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH ₃ -	1	2
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH ₃ -	1	2
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH ₃ -	1	2
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH ₃ -	1	2
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH ₃ -	1	2
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH ₃ -	1	2

[0016]

[表2]

表-1(つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	I	13
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	F-	1	3	
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	Cl-	1	3	
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	OC ₂ H ₅ -	1	3	
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH ₃ -	1	3	
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH ₃ -	1	3	
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH ₃ -	1	3	
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH ₃ -	1	3	
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH ₃ -	1	3	
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH ₃ -	1	3	
H	H	2-N ₂ Py	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH ₃ -	1	3	

[表3]

15

16

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
[図4]	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	2
	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	2
	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	2
	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	2
	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	2
	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	2
	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	2
	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	2
	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	2
	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	2

17

18

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
[図5]	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	3
	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	3
	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	3
	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	3
	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	3
	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	3
	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	3
	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	3
	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	3
	H	H	-CH ₂ CH ₂ N	-CH ₃	H	H		1	3

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-F-phenyl	1	2
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-F-phenyl	1	2
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-Cl-phenyl	1	2
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-Cl-phenyl	1	2
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-OCH ₃ -phenyl	1	2
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-CH ₃ -2-phenyl	1	2
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-CH ₃ -2-phenyl	1	2
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-CH ₃ -2-phenyl	1	2
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-CH ₃ -2-phenyl	1	2
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-CH ₃ -2-phenyl	1	2

(11)

特開平10-306078
20

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-F-phenyl	1	3
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-F-phenyl	1	3
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-Cl-phenyl	1	3
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-Cl-phenyl	1	3
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-OCH ₃ -phenyl	1	3
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-CH ₃ -2-phenyl	1	3
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-CH ₃ -2-phenyl	1	3
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-CH ₃ -2-phenyl	1	3
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-CH ₃ -2-phenyl	1	3
H	H	4-N ⁺ (CH ₃) ₂ N	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-CH ₃ -2-phenyl	1	3

(12)

特開平10-306078
22

[0022]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	23
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
[R8]	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	

(13)

特開平10-306078
24

[0023]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	25
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
[R9]	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	

(14)

特開平10-306078
26

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	27
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	(15)
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	

特開平10-306078
28

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	29
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	(16)
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	

特開平10-306078
30

31

32

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-N ₂ pyr	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	F-phenyl	1	2
H	H	4-N ₂ pyr	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	phenyl-F	1	2
H	H	4-N ₂ pyr	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	O-phenyl	1	2
H	H	4-N ₂ pyr	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	phenyl-Cl	1	2
H	H	4-N ₂ pyr	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	phenyl-OCH ₃	1	2
H	H	4-N ₂ pyr	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH-phenyl	1	2
H	H	4-N ₂ pyr	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	phenyl-CH ₃	1	2
H	H	4-N ₂ pyr	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH ₃ -phenyl-CH ₃	1	2
H	H	4-N ₂ pyr	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH ₃ -phenyl-CH ₃	1	2

[表1-2]

[0027]

33

34

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-N ₂ pyr	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	F-phenyl	1	3
H	H	4-N ₂ pyr	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	phenyl-F	1	3
H	H	4-N ₂ pyr	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	O-phenyl	1	3
H	H	4-N ₂ pyr	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	phenyl-Cl	1	3
H	H	4-N ₂ pyr	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	phenyl-OCH ₃	1	3
H	H	4-N ₂ pyr	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH-phenyl	1	3
H	H	4-N ₂ pyr	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	phenyl-CH ₃	1	3
H	H	4-N ₂ pyr	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH ₃ -phenyl-CH ₃	1	3
H	H	4-N ₂ pyr	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	CH ₃ -phenyl-CH ₃	1	3

[表1-3]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	35
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	

(19)

特開平10-306078
36

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	37
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	

(20)

特開平10-306078
38

[030]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	I
H	H	3- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	3- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	3- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	3- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	3- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	3- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	3- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	3- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	3- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	3- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	3- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	3- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2

[四一六九一]

(121)

特開平10-306078

(22)

特開平10-306078

10031

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H	3- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	41
H	H	3- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H	3- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H	3- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H	3- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H	3- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H	3- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H	3- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	H	3- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	42
H	H	3- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	

[0032]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-N=N-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	4-N=N-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	4-N=N-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	4-N=N-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	4-N=N-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	4-N=N-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	4-N=N-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	4-N=N-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	H	4-N=N-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2

(23)

特開平10-306078
44

[0033]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-N=N-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-N=N-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-N=N-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-N=N-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-N=N-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-N=N-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-N=N-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-N=N-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-N=N-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3

(24)

特開平10-306078
46

48

47

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2

[0034]

49

50

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2

[0035]

[表21]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	(27)
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	2	

(27)

特開平10-306078

52

(28)

特開平10-306078

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	(28)
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	
H	Z-OCH ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3	

(28)

特開平10-306078

54

55

56

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3

[0038]

[図24]

[0039]

[図25]

57

58

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3
H	-OCB ₃		-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H		1	3

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l		
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₃ CH ₃	-OCH ₃	H	H		1	2	59	
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H		1	2		
H	2-OCH ₃		-CH ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H		1	2		
H	2-OCH ₃		-CH ₃	-OCH ₃	H	H		1	2		
H	2-OCH ₃		H	-OCH ₃	H	H		1	2		
[表26]	H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₃ CH ₃	-OCH ₃	H	H		1	2	(31)
	H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H		1	2	
	H	2-OCH ₃		-CH ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H		1	2	
	H	2-OCH ₃		-CH ₃	-OCH ₃	H	H		1	2	
	H	2-OCH ₃		H	-OCH ₃	H	H		1	2	

(31)

特開平10-306078

60

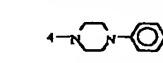
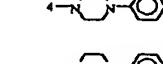
61

(32)

62

特開平10-306078

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l		
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₃ CH ₃	-OCH ₃	H	H		1	2		
H	2-OCH ₃		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H		1	2		
H	2-OCH ₃		-CH ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H		1	2		
H	2-OCH ₃		-CH ₃	-OCH ₃	H	H		1	2		
H	2-OCH ₃		H	-OCH ₃	H	H		1	2		
[表27]	H	H		-(CH ₂) ₃ CH ₃	-OCH ₃	H	H		1	2	
	H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H		1	2	
	H	H		-CH ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H		1	2	
	H	H		-CH ₃	-OCH ₃	H	H		1	2	
	H	H		H	-OCH ₃	H	H		1	2	

63

64

[0042]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-N(Phenyl)-1-pyridyl	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-○-	1	2
H	H	4-N(Phenyl)-1-pyridyl	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-○-	1	2
H	H	4-N(Phenyl)-1-pyridyl	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-○-	1	2
H	H	4-N(Phenyl)-1-pyridyl	-CH ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-○-	1	2
H	H	4-N(Phenyl)-1-pyridyl	-CH ₃	-OCH ₃	H	H	-○-	1	2
H	H	4-N(Phenyl)-1-pyridyl	H	-OCH ₃	H	H	-○-	1	2
H	H	4-OCH ₂ -1-pyridyl	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-○-	1	2
H	H	4-OCH ₂ -1-pyridyl	-(CH ₂) ₃ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-○-	1	2
H	H	4-OCH ₂ -1-pyridyl	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-○-	1	2
H	H	4-OCH ₂ -1-pyridyl	-CH ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-○-	1	2
H	H	4-OCH ₂ -1-pyridyl	-CH ₃	-OCH ₃	H	H	-○-	1	2
H	H	4-OCH ₂ -1-pyridyl	H	-OCH ₃	H	H	-○-	1	2

[表28]

66

[0043]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	2-OCH ₃	5-N(Phenyl)-1-pyrazinyl	-(CH ₂) ₃ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-○-	1	3
H	2-OCH ₃	5-N(Phenyl)-1-pyrazinyl	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-○-	1	3
H	2-OCH ₃	5-N(Phenyl)-1-pyrazinyl	-CH ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-○-	1	3
H	2-OCH ₃	5-N(Phenyl)-1-pyrazinyl	-CH ₃	-OCH ₃	H	H	-○-	1	3
H	2-OCH ₃	5-N(Phenyl)-1-pyrazinyl	H	-OCH ₃	H	H	-○-	1	3
H	2-OCH ₃	5-N(Phenyl)-1-pyrazinyl	-(CH ₂) ₃ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-○-	1	3
H	2-OCH ₃	5-N(Phenyl)-1-pyrazinyl	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-○-	1	3
H	2-OCH ₃	5-N(Phenyl)-1-pyrazinyl	-CH ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-○-	1	3
H	2-OCH ₃	5-N(Phenyl)-1-pyrazinyl	-CH ₃	-OCH ₃	H	H	-○-	1	3
H	2-OCH ₃	5-N(Phenyl)-1-pyrazinyl	H	-OCH ₃	H	H	-○-	1	3

[表29]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	-OCH ₃		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-	1	3
H	-OCH ₃		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-	1	3
H	-OCH ₃		-CH ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-	1	3
H	-OCH ₃		-CH ₃	-OCH ₃	H	H	-	1	3
H	-OCH ₃		H	-OCH ₃	H	H	-	1	3
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-	1	3
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-	1	3
H	H		-CH ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-	1	3
H	H		-CH ₃	-OCH ₃	H	H	-	1	3
H	H		H	-OCH ₃	H	H	-	1	3

67

(35)

特開平10-306078

68

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-	1	3	
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-	1	3	
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-	1	3	
H	H		-CH ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-	1	3	
H	H		-CH ₃	-OCH ₃	H	H	-	1	3	
40	H	H		H	-OCH ₃	H	H	-	1	3
[表31]	H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-	1	3
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-	1	3	
H	H		-CH ₂ CH ₃	-OCH ₃	H	H	-	1	3	
H	H		-CH ₃	-OCH ₃	H	H	-	1	3	
H	H		H	-OCH ₃	H	H	-	1	3	

69

(36)

特開平10-306078

70

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	-(CH ₂) ₃ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	2	71
H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	2	
H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	-CH ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	2	
H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	-CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	2	
H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	2	
[表3.2]	H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	-(CH ₂) ₃ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	2
	H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	2
	H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	-CH ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	2
	H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	-CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	2
	H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	2

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	-(CH ₂) ₃ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	3	73
H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	3	
H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	-CH ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	3	
H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	-CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	3	
H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	3	
[表3.3]	H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	-(CH ₂) ₃ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	3
	H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	3
	H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	-CH ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	3
	H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	-CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	3
	H	2-OCH ₃	<chem>S-N1C=CN=C1</chem>	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	- <chem>c1ccccc1</chem>	1	3

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	2-OCH ₃	S-N ⁺ (N ₂) ₂	-(CH ₂) ₃ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	2	75
H	2-OCH ₃	S-N ⁺ (N ₂) ₂	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	2	
H	2-OCH ₃	S-N ⁺ (N ₂) ₂	-CH ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	2	
H	2-OCH ₃	S-N ⁺ (N ₂) ₂	-CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	2	
H	2-OCH ₃	S-N ⁺ (N ₂) ₂	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	2	
H	H	-N ₂ CH- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	2	
H	H	-N ₂ CH- 	-(CH ₂) ₃ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	2	
H	H	-N ₂ CH- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	2	
H	H	-N ₂ CH- 	-CH ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	2	
H	H	-N ₂ CH- 	-CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	2	
H	H	-N ₂ CH- 	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	2	

(39)

特開平10-306078

75

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	2-OCH ₃	S-N ⁺ (N ₂) ₂	-(CH ₂) ₃ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	3	77
H	2-OCH ₃	S-N ⁺ (N ₂) ₂	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	3	
H	2-OCH ₃	S-N ⁺ (N ₂) ₂	-CH ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	3	
H	2-OCH ₃	S-N ⁺ (N ₂) ₂	-CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	3	
H	2-OCH ₃	S-N ⁺ (N ₂) ₂	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	3	
H	H	-N ₂ CH- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	3	
H	H	-N ₂ CH- 	-(CH ₂) ₃ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	3	
H	H	-N ₂ CH- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	3	
H	H	-N ₂ CH- 	-CH ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	3	
H	H	-N ₂ CH- 	-CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	- 	1	3	
H	H	-N ₂ CH- 	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-	1	3	

(40)

特開平10-306078

78

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	-N(Phenyl)-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	2
H	H	-N(Phenyl)-	-(CH ₂) ₃ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	2
H	H	-N(Phenyl)-	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	2
H	H	-N(Phenyl)-	-CH ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	2
H	H	-N(Phenyl)-	-CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	2
H	H	-N(Phenyl)-	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	2
[表36]	H	-OCH ₂ -	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	2
	H	-OCH ₂ -	-(CH ₂) ₃ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	2
	H	-OCH ₂ -	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	2
	H	-OCH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	2
	H	-OCH ₂ -	-CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	2
	H	-OCH ₂ -	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	2

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	-N(Phenyl)-	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	3
H	H	-N(Phenyl)-	-(CH ₂) ₃ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	3
H	H	-N(Phenyl)-	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	3
H	H	-N(Phenyl)-	-CH ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	3
H	H	-N(Phenyl)-	-CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	3
H	H	-N(Phenyl)-	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	3
[表37]	H	-OCH ₂ -	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	3
	H	-OCH ₂ -	-(CH ₂) ₃ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	3
	H	-OCH ₂ -	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	3
	H	-OCH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	3
	H	-OCH ₂ -	-CH ₃	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	3
	H	-OCH ₂ -	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-Phenyl-	1	3

[0051]

[表37]

[0050]

〔43〕

特開平10-306078
84

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	83
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -N ₂ C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -N ₂ C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -N ₂ C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -N ₂ C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -N ₂ C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -N ₂ C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	

〔44〕

特開平10-306078
86

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	85
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -N ₂ C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -N ₂ C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -N ₂ C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -N ₂ C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -N ₂ C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -N ₂ C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	

〔0053〕

〔表39〕

〔0052〕

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H		H	-CH ₃	H	H		1	2
H	H		H	-CH ₃	H	H		1	2
H	H		H	-CH ₃	H	H		1	2
H	H		H	-CH ₃	H	H		1	2
H	H		H	-CH ₃	H	H		1	2
H	H		H	-CH ₃	H	H		1	2
H	H		H	-CH ₃	H	H		1	2

[0054]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H		H	-CH ₃	H	H		1	3
H	H		H	-CH ₃	H	H		1	3
H	H		H	-CH ₃	H	H		1	3
H	H		H	-CH ₃	H	H		1	3
H	H		H	-CH ₃	H	H		1	3
H	H		H	-CH ₃	H	H		1	3

[0055]

(0056)

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H	2-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	91
H	H	3-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	2-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	3-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	2-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	3-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	

(47)

特開平10-306078

[0057]

表-1 (つづき)

(48)

转贴于 0-306078

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
[R44]	H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	1	2
	H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	1	2
	H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	1	2
	H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	1	2
	H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	1	2
	H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	1	2
	H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	1	2
	H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	1	2
[0059]	H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	1	3
	H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	1	3
	H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	1	3
	H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	1	3
	H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	1	3
	H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	1	3
	H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	1	3
	H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	1	3

95

(49)

96

特開平10-306078

97

(50)

98

特開平10-306078

[0060]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	99
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H	4-OCH ₂ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅ -CH ₃	1	2	
H	H	4-OCH ₂ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅ -CH ₃	1	2	

(51)

特開平10-306078
100

[0061]

[0061]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	101
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H	4-OCH ₂ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅ -CH ₃	1	3	
H	H	4-OCH ₂ -C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅ -CH ₃	1	3	

(52)

特開平10-306078
102

[0062]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	103
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	2	

[0063]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	105
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	
H	H		-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	1	3	

[0063]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	2-N ⁺ —N	—(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₄ —CH ₃	1	2
H	H	3-N ⁺ —N	—(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₄ —CH ₃	1	2
H	H	4-N ⁺ —N	—(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₄ —CH ₃	1	2
H	H	2-N ⁺ —N	—(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₄ —CH ₃	1	2
H	H	3-N ⁺ —N	—(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₄ —CH ₃	1	2
H	H	4-N ⁺ —N	—(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₄ —CH ₃	1	2
H	H	2-N ⁺ —N	—(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₄ —CH ₃	1	2
H	H	3-N ⁺ —N	—(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₄ —CH ₃	1	2
H	H	4-N ⁺ —N	—(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₄ —CH ₃	1	2

[0064]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	2-N ⁺ —N	—(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₄ —CH ₃	1	3
H	H	3-N ⁺ —N	—(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₄ —CH ₃	1	3
H	H	4-N ⁺ —N	—(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₄ —CH ₃	1	3
H	H	2-N ⁺ —N	—(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₄ —CH ₃	1	3
H	H	3-N ⁺ —N	—(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₄ —CH ₃	1	3
H	H	4-N ⁺ —N	—(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₄ —CH ₃	1	3
H	H	2-N ⁺ —N	—(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₄ —CH ₃	1	3
H	H	3-N ⁺ —N	—(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₄ —CH ₃	1	3
H	H	4-N ⁺ —N	—(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₄ —CH ₃	1	3

[0065]

[0064]

111

112

113

114

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	2

{表52}

{0067}

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₂ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	3

{表53}

[0068]

表一！(つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	I
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₄ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₃ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₁ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₀ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₆	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -CH ₃	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -O	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2
H	H	4-OCH ₂ -C ₆ H ₄ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2
H	H	4-OCH ₂ -C ₆ H ₅	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2
H	H	2-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₆	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2

115

(65)

特開平10-306078

[6900]

表-1 (つづき)

111

1001

118

表-1(つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H		H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2
H	H		H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2
H	H		H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2
H	H		H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2
H	H		H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2
H	H		H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2
H	H		H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2

[表56]

表-1(つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H		H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	3
H	H		H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	3
H	H		H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	3
H	H		H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	3
H	H		H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	3
H	H		H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	3
H	H		H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	3

[表57]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H	2-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2	123
H	H	3-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2	
H	H	4-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2	
H	H	2-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2	
H	H	3-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2	
H	H	4-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2	
H	H	2-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2	
H	H	3-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2	
H	H	4-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	2	

[表58]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H	2-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	3	125
H	H	3-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	3	
H	H	4-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	3	
H	H	2-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	3	
H	H	3-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	3	
H	H	4-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	3	
H	H	2-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	3	
H	H	3-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	3	
H	H	4-N ₂ N	H	-CH ₃	H	H	-C ₆ H ₅	0	3	

[0073]

[表59]

127

表-1(つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	0	2
H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	0	2
H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	0	2
H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	0	2
H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	0	2
H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	0	2
H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	0	2
H	H	4-S- 	H	-CH ₃	H	H	- 	0	2

[表60]

128

表-1(つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-S- 	-(CH ₂) ₄ CH ₃	-CH ₃	H	H	- 	1	3

[表61]

[0076]

(67)

特許平10-306078
132

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄	H	-CH ₃	H	H	—	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N ₂	H	-CH ₃	H	H	—	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N ₂ C ₆ H ₄	H	-CH ₃	H	H	—	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N ₂ C ₆ H ₄ N ₂	H	-CH ₃	H	H	—	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N ₂ C ₆ H ₄ O	H	-CH ₃	H	H	—	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N ₂ CH ₃	H	-CH ₃	H	H	—	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N ₂	H	-CH ₃	H	H	—	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ O	H	-CH ₃	H	H	—	1	2
H	H	4-OCH ₂ C ₆ H ₄	H	-CH ₃	H	H	—	1	2
H	H	4-OCH ₂ C ₆ H ₄ N ₂	H	-CH ₃	H	H	—	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N ₂ C ₆ H ₄ N ₂ C ₆ H ₄ N ₂	H	-CH ₃	H	H	—	1	2

[0077]

(68)

特許平10-306078
134

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄	H	-CH ₃	H	H	—	1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N ₂	H	-CH ₃	H	H	—	1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N ₂ C ₆ H ₄	H	-CH ₃	H	H	—	1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N ₂ C ₆ H ₄ N ₂	H	-CH ₃	H	H	—	1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N ₂ C ₆ H ₄ O	H	-CH ₃	H	H	—	1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N ₂ CH ₃	H	-CH ₃	H	H	—	1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N ₂	H	-CH ₃	H	H	—	1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ O	H	-CH ₃	H	H	—	1	3
H	H	4-OCH ₂ C ₆ H ₄	H	-CH ₃	H	H	—	1	3
H	H	4-OCH ₂ C ₆ H ₄ N ₂	H	-CH ₃	H	H	—	1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N ₂ C ₆ H ₄ N ₂ C ₆ H ₄ N ₂	H	-CH ₃	H	H	—	1	3

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	I
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-CH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-CH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-CH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-CH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N-CH ₃	H	-CH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-CH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ CH ₃	H	-CH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ O	H	-CH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ N	H	-CH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ N	H	-CH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-CH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2

精明 10-306078

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-N- 	H	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-N- 	H	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-N- 	H	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-N- 	H	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-N- 	H	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-N- 	H	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-N- 	H	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-N- 	H	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-N- 	H	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-OCH ₂ - 	H	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-OCH ₂ - 	H	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-OCH ₂ - 	H	-CH ₃	H	H		1	3
H	H	4-N- 	H	-CH ₃	H	H		1	3

特明平10-306078

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2	139
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N-CH ₃	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ O	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2	
H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ N	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2	
H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ N	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ O	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2	

[0080]

[0081]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3	141
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N-CH ₃	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ O	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3	
H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ N	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3	
H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ N	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3	
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ O	H	-N(CH ₃) ₂	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3	

[0087]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -CH ₃	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -CH ₃	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ O	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	2
H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	2
H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -CH ₂ NH	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	2

[0082]

[0083]

[0089]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -CH ₃	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -CH ₃	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ O	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	3
H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	3
H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ -CH ₂ NH	H	-N(CH ₃) ₂	H	H		1	3

[488001]

表一1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-OCH ₂ - 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-OCH ₂ - 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	2
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	2

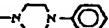
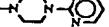
147

175

特開平10-306078

[0085]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	i
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-OCH ₂ - 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-OCH ₂ - 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	3
H	H	4-N- 	H	-OCH ₃	H	H	- 	1	3

149

(76)

特明平10-306078

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N-CH ₃	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ CH ₃	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ O	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ N	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ N	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	2

[表72]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N-CH ₃	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ CH ₃	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ O	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3
H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ N	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3
H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ N	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3
H	H	4-N ₂ C ₆ H ₄ N	H	-OCH ₃	H	H	-N ₂ C ₆ H ₄ N	1	3

[表73]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	$\text{Z}-\text{OCH}_3$	$\text{S}-\text{N}^{\oplus}(\text{C}_6\text{H}_4)-\text{N}^{\ominus}$	$-(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$	H	H		1	2
H	$\text{Z}-\text{OCH}_3$	$\text{S}-\text{N}^{\oplus}(\text{C}_6\text{H}_4)-\text{N}^{\ominus}$	$-(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$	H	H		1	2
H	$\text{Z}-\text{OCH}_3$	$\text{S}-\text{N}^{\oplus}(\text{C}_6\text{H}_4)-\text{N}^{\ominus}$	$-(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$	H	H		1	2
H	$\text{Z}-\text{OCH}_3$	$\text{S}-\text{N}^{\oplus}(\text{C}_6\text{H}_4)-\text{N}^{\ominus}$	$-(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$	-OH	H		1	2
H	$\text{Z}-\text{OCH}_3$	$\text{S}-\text{N}^{\oplus}(\text{C}_6\text{H}_4)-\text{N}^{\ominus}$	$-(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$	H	4-OH		1	2
H	$\text{Z}-\text{OCH}_3$	$\text{S}-\text{N}^{\oplus}(\text{C}_6\text{H}_4)-\text{N}^{\ominus}$	$-(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$	H	5-OH		1	2

[0088]

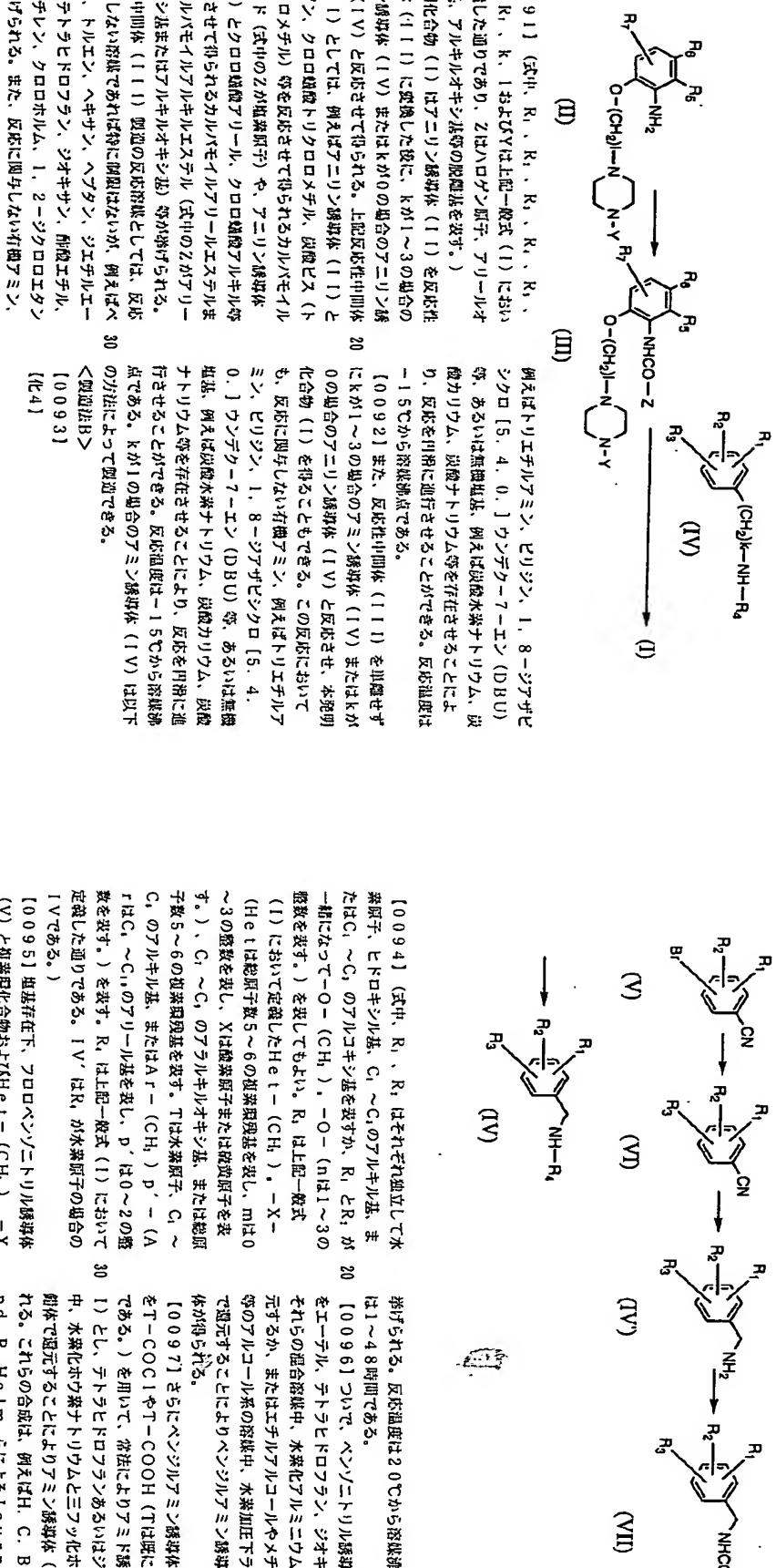
[0089] 次に本発明化合物の製造法について説明する。

<製造法A>

[0090]
[0091]

表-1 (つづき)

R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	Y	k	l
H	$\text{Z}-\text{OCH}_3$	$\text{S}-\text{N}^{\oplus}(\text{C}_6\text{H}_4)-\text{N}^{\ominus}$	$-(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$	H	H		1	3
H	$\text{Z}-\text{OCH}_3$	$\text{S}-\text{N}^{\oplus}(\text{C}_6\text{H}_4)-\text{N}^{\ominus}$	$-(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$	H	H		1	3
H	$\text{Z}-\text{OCH}_3$	$\text{S}-\text{N}^{\oplus}(\text{C}_6\text{H}_4)-\text{N}^{\ominus}$	$-(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$	H	H		1	3
H	$\text{Z}-\text{OCH}_3$	$\text{S}-\text{N}^{\oplus}(\text{C}_6\text{H}_4)-\text{N}^{\ominus}$	$-(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$	-OH	H		1	3
H	$\text{Z}-\text{OCH}_3$	$\text{S}-\text{N}^{\oplus}(\text{C}_6\text{H}_4)-\text{N}^{\ominus}$	$-(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$	H	4-OH		1	3
H	$\text{Z}-\text{OCH}_3$	$\text{S}-\text{N}^{\oplus}(\text{C}_6\text{H}_4)-\text{N}^{\ominus}$	$-(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$	H	5-OH		1	3



[0091] (式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 k 、 Y および Z は上記一般式(1)において定義した通りであり、 Z はハロゲン原子、アリールオキシ基、アルキルオキシ基等の脱離基を表す。)

本発明化合物(1)はアニリン誘導体(1')を反応性中間体(1'')に変換した後、 k が1～3の場合のアミン誘導体(1'')または k が0の場合のアニリン誘導体(1')と反応させて得られる。上記反応性中間体(1'')としては、例えばアニリン誘導体(1')とホスゲン、クロロ堿値トリクロロメチル、炭酸ビス(トリクロロメチル)等を反応させて得られるカルバモイルトリクロロメチル等を反応させて得られるアルカリエーステル(式中の Z がアリルオキシ基またはアルキルオキシ基)等が挙げられる。

クロド(式中の Z が塩素原子)や、アニリン誘導体(1')と(1'')とでは、例えばアニリン誘導体(1')とホスゲン、クロロ堿値トリクロロメチル、炭酸ビス(トリクロロメチル)等を反応させて得られるカルバモイルトリールエーステルまたはカルバモイルアルカリエーステル(式中の Z がアリルオキシ基またはアルキルオキシ基)等が挙げられる。

反応性中間体(1'')製造の反応溶媒としては、反応に関与しない溶媒であれば特に問題はないが、例えばベンゼン、トルエン、ヘキサン、ヘブタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、酢酸エチル、塩化メチレン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等が挙げられる。また、反応に関与しない有機アミン、

[0092] 例えばトリエチルアミン、ピリジン、1, 8-ジアツビシクロ[5. 4. 0.]ウニデンケーチ-エン(DBU)等、あるいは無機塩基、例えば炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等を存在させることにより、反応が円滑に行なえることができる。反応温度は-15℃から溶媒沸点である。

[0093] また、反応性中間体(1'')を川瀬せずして得られる。上記反応性中間体(1'')または k が0の場合のアニリン誘導体(1')と反応させ、本発明化合物(1)を得ることもできる。この反応においても、反応に関与しない有機アミン、例えばトリエチルアミン、ピリジン、1, 8-ジアツビシクロ[5. 4. 0.]ウンデンケーチ-エン(DBU)等、あるいは無機塩基、例えば炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等を存在させることにより、反応が円滑に行なえることができる。反応温度は-15℃から溶媒沸点である。kが1の場合のアニリン誘導体(1')は以下のようにして得られる。

[0094] (式中、 R_1 、 R_2 はそれぞれ独立して水素原子、ヒドロキル基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ のアルキル基、または $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ のアルコキシ基を表すか、 R_1 と R_2 が一組になって-O-(CH_2)_n-O-(CH_2)_mで表す。)を表してもよい。 R_3 は上記一般式(1)において定義した $\text{He}-\text{t}-(\text{CH}_2)_n-\text{X}-\text{He}$ (He は總原子数5～6の複素環誘導基を表し、 m は0～3の整数を表し、 X は總原子または總原子を表す。)、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ のアラルキルオキシ基、または總原子数5～6の複素環誘導基を表す。 T は水素原子、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ のアルキル基、または $\text{Ar}-\text{t}-(\text{CH}_2)_n-\text{D}'-(\text{Ar})$ (Ar は $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ のアリール基を表し、 D' は0～2の整数を表す。)を表す。 R_4 は上記一般式(1)において定義した通りである。 I' は R_4 が水素原子の場合の I' である。)

[0095] 塩基存在下、フロロベンゾニトリル誘導体(V)と複素環化合物および $\text{He}-\text{t}-(\text{CH}_2)_n-\text{X}-\text{He}$ (He は t 、 m 、 X は上記一般式(1)において定義した通りである。)反応させることにより、ベンゾニトリル誘導体(VI)が得られる。この場合の反応溶媒としては反応に関与しない溶媒であれば特に問題はないが、例えばベンゼン、トルエン、テトラヒドロフラン、ジオキサン、クロロホルム、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキサイド、メチルビロリド等が挙げられる。また、塩基としては反応に関与しない有機アミン、例えばトリエチルアミン、ピリジン、1, 8-ジアツビシクロ[5. 4. 0.]ウンデンケーチ-エン(DBU)等、あるいは無機塩基、例えば炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等が

挙げられる。反応温度は20℃から溶媒沸点、反応時間は1～4.8時間である。

[0096] ついで、ベンゾニトリル誘導体(VI)をエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、またはそれらの混合溶媒中、水素化アルミニウムリチウムで還元するか、またはエチルアルコールやメチルアルコール等のアルコール系の溶媒中、水素加圧下ラネーニックケルで還元することによりベンジルアミン誘導体(VII)が得られる。

[0097] さらにベンジルアミン誘導体(VII)をT-COC₂やT-COOH(Tは既に定義した通りである。)を用いて、常法によりアミド誘導体(VI)とし、テトラヒドロフランあるいはジオキサン溶媒中、水素化カルボナトリウムと三フッ化ホウ素エーテル等で還元することによりアミン誘導体(VI)が得られる。これらの合成は、例えばH. C. Brown and P. HeimらによるJournal of Organic Chemistry, 38, 912 (1973)に記載の方法に従えばよい。また、アミン誘導体(VI)は、テトラヒドロフランあるいはジオキサン溶媒中、水素化カルボナトリウムと酢酸で還元することによっても得られる。これらの合成は、例えばN. UminoらによるTetrahedron Letters, 7, 63 (1976)に記載の方法に従えばよい。また、 k が1の場合のアミン誘導体(VI)は以下の方法によつてでも製造できる。

[0098] <製法A>

[0099]

[0100]

[0101]

[0102]

[0103]

[0104]

[0105]

[0106]

[0107]

[0108]

[0109]

[0110]

[0111]

[0112]

[0113]

[0114]

[0115]

[0116]

[0117]

[0118]

[0119]

[0120]

[0121]

[0122]

[0123]

[0124]

[0125]

[0126]

[0127]

[0128]

[0129]

[0130]

[0131]

[0132]

[0133]

[0134]

[0135]

[0136]

[0137]

[0138]

[0139]

[0140]

[0141]

[0142]

[0143]

[0144]

[0145]

[0146]

[0147]

[0148]

[0149]

[0150]

[0151]

[0152]

[0153]

[0154]

[0155]

[0156]

[0157]

[0158]

[0159]

[0160]

[0161]

[0162]

$\xrightarrow{\hspace{1cm}}$

$$\begin{array}{c} \text{R}_2 \\ | \\ \text{R}'_1-\text{C}=\text{C}-\text{C}(\text{R}_3)-\text{CH}_2-\text{NH}- \\ | \\ \text{O} \\ \diagdown \\ \text{V} \end{array}$$

(IV''')

The diagram illustrates two chemical reactions. In the first, a nitro group (NO_2) on a benzene ring substituted with R_1 and R_2 is reduced to an amino group (NH_2). In the second, a similar molecule with a nitro group is reduced, but the resulting amino group is shown with a dot above it, indicating it is a radical.

[0099] (式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 はそれぞれ強度)

（アカルキシル基を表すか、R₁とR₂が一緒にない）を表してもよく、Vはフェニル基またはピリジル基を表し、R₁は上記一般式（1）において定義した通りである。）Vがフェニル基の場合は、塩基存在下、ハイドロキシンモノトリル誘導体（V'）と塩酸ベンジルまたは臭化ベンジル等と反応させ、Vがビリジル基の場合はクロロメチルビリジンの塩酸水素鉄塩等と反応させることにより、ベンゾニトリル誘導体（V'')が得られる。この場合の反応結果としては反応に初期しない30溶媒であれば特に制限はないが、例えばベンゼン、トルエン、ナトラヒドロフラン、シオキサン、クロロホルム、アセタン、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキサイド、N-メチルピロリドン等が挙げられる。

（アミド法）>

101011

[化6]

卷之三

(0-102) (式4)、 R_1 、 R_2 、 R_3 はそれぞれ並んで以下で水素結合子、 $C_1 \sim C_6$ のアルコキシ基、 $Het - (C_1 H_1)$ 、 $- (H_2 C_1$ 、 m は前記定義に同じ)、または $C_1 \sim C_6$ のアラルキリオキシン基を表すか R_1 と R_2 が一極になって $-O-$ ($C_1 H_1$)、 $-O-$ ($n=1 \sim 3$ の整数)

含有する炭原子数5～6の直鎖環状基を表し、R₄は上記一般式(1)において定義した通りである。)
[0103]メチルアルコール、エチルアルコール、イソプロピルアルコール等のアルコール系溶媒中およびテ

165

トライドロフランあるいはジオキサン溶液中、あるいは
それらの混合溶媒中、プロモベンズアルヒド誘導体
(VII) に R_1-NH_2 (R_1 は上記一般式 (I)
において定義した通りである) を反応温度 $-10^{\circ}C$ ~
溶媒沸点の条件下 $1\sim2.4$ 時間反応させてイミン誘導
体 (IX) とし、これを粗離せずに水溶液ホウ素ナトリ
ウム等の還元剤で還元することによって、プロモベンジ
アルミニン誘導体 (X) が得られる。反応温度は $-10^{\circ}C$
~溶媒沸点であり、反応時間は $1\sim10$ 時間である。つ
いで、Young S. L. らによる Journal of
Medicinal Chemistry, 1967, 10, 10 [化7-14] に記載
される。

166

トライヒドロフランあるいはジオキサン溶媒中、あるいは
それらの混合溶媒中、プロモベンズアルヒドリヒドロシア
(VII) に、R₁-NH₂ (R₁ は上記一般式 (I)
において定義した通りである。) を反応温度 -10 ℃ ～
溶媒沸点の条件下で 1 ～ 2.4 時間反応させてイミン誘導
体 (IX) とし、これを単離せずに水酸化カリウムナトリ
ウム等の還元剤で還元することによって、プロモベンジ
ルアーミン誘導体 (X) が得られる。反応温度は -10 ℃ ～
溶媒沸点であり、反応時間は 1 ～ 10 時間である。つ
いで、Young S. L. らによる Journal of Medicinal Chemistry, 10
[67] (1967) 992, vol. 1, 35, No. 4, 4790-479
に記載の硝酸銀による合壁型脱水環化合物のカップリ
ング反応の方法を用いてプロモベンジルアーミン誘導体
(X) を金属原子を 1 ～ 4 倍含むする総原子数 5 ～ 6 の
複数環化合物と反応させてアミニン誘導体 (IV) を得る
ことができる。また、K₂O の場合のアミニン誘導体
(IV) は以下の方法によって製造できる。
<製造法 E>
[0104]

(IX)

(X)

(IV)

〔0105〕式中、 R_1 、 R_1' はそれぞれ独立して水溶基、 $C_1 \sim C_n$ のアルキル基、または $C_1 \sim C_n$ のアルコキシ基を有すか、 R_1 と R_1' が一結合になって $-O-(CH_2)_n-O-$ ($n=1 \sim 3$ の整数を表す)と表してもよい。 R_2 は上記一般式(I)において定義した $He-t-(CH_2)_n-X-$ ($He-t$ は總原子数5～6の烷基環状基を表し、 $m=0$ ～3の整数を表し、 X は能電原子または能電原子を表す。)、 C_1 のアルキルオキシ基、または總原子数5～6の環状環状基を表す。	メチルホルムアミド、ジメチルスルホキサイド、N-メチルピロリドン等が選択される。また、塩基としては反応に関与しない有機アミン、例えばトリエチルアミン、ビリジン、1、8-ジアゼビシン $[5.4.0.]$ ウントケ-7-エン(DBU)等、あるいは無機塩基、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等が挙げられる。反応温度は20℃から溶媒沸点、反応時間は1～4.8時間である。
〔0106〕塩基存在下、フッロニトロベンゼン誘導体(X-I)と複素環化合物およびHe-t-(CH ₂) _n -X(He-t、m、Xは上記一般式(I)において定義した通りである。)と反応させることにより、二トロベンゼン誘導体(X-II)が得られる。 イソトロニトロベンゼン	〔0107〕次に二トロベンゼン誘導体(X-III)をアルコール浴槽中でPd-炭素触媒の存在下に接触水素添加を行うか、アルコール-水浴槽中、銅-酢酸による還元等の常法の二トロ基の還元を行うことによりアミニン誘導体(IV)が得られる。上記のアミニン誘導体(IV)は以下の方針によって製造できる。

表-2 (つづき)

実施例 No.	構 造	^1H NMR
8		DMSO-d ₆ +MeOH-d ₄ $\delta = 2.30(\text{m}, 5\text{H}), 3.08(\text{m}, 2\text{H}), 3.27-3.63(\text{m}, 14\text{H}),$ $4.06(\text{m}, 6\text{H}), 4.35(\text{s}, 2\text{H}), 6.74(\text{d}, 1\text{H}), 6.87(\text{d}, 1\text{H}),$ $6.95-7.16(\text{m}, 9\text{H}), 7.33(\text{m}, 5\text{H}), 7.95(\text{m}, 1\text{H}),$ $8.09(\text{d}, 1\text{H})$
9		DMSO-d ₆ $\delta = 2.22(\text{s}, 3\text{H}), 2.33(\text{s}, 3\text{H}), 3.00-3.35(\text{m}, 4\text{H}), 3.35-3.80(\text{m}, 8\text{H}),$ $4.06(\text{t}, 3\text{H}), 6.80-7.00(\text{m}, 5\text{H}), 7.23(\text{t}, 2\text{H}), 7.62(\text{d}, 2\text{H}), 7.72(\text{d}, 2\text{H}),$ $7.87(\text{s}, 1\text{H}), 8.36(\text{s}, 1\text{H}), 9.50(\text{s}, 1\text{H}), 10.49(\text{s}, 1\text{H}), 10.69(\text{s}, 1\text{H})$
10		DMSO-d ₆ $\delta = 2.09(\text{s}, 3\text{H}), 2.22(\text{s}, 1\text{H}), 3.00-3.85(\text{m}, 12\text{H}), 4.07(\text{s}, 1\text{H}),$ $6.86(\text{t}, 3\text{H}), 6.97(\text{d}, 2\text{H}), 7.10(\text{t}, 1\text{H}), 2.84(\text{t}, 4\text{H}), 7.24(\text{t}, 2\text{H}),$ $7.48(\text{d}, 2\text{H}), 7.70-7.90(\text{m}, 4\text{H}), 8.40(\text{s}, 1\text{H}), 10.58(\text{s}, 1\text{H}),$ $10.74(\text{s}, 1\text{H})$
11		DMSO-d ₆ $\delta = 1.18(\text{t}, 3\text{H}), 2.23(\text{s}, 5\text{H}), 2.83(\text{q}, 2\text{H}), 3.00-3.80(\text{m}, 10\text{H}),$ $4.07(\text{t}, 2\text{H}), 6.86(\text{t}, 3\text{H}), 6.97(\text{d}, 2\text{H}), 7.10(\text{t}, 1\text{H}), 7.25(\text{t}, 3\text{H}),$ $7.47(\text{d}, 2\text{H}), 7.70-7.80(\text{m}, 4\text{H}), 8.40(\text{s}, 1\text{H}), 10.60(\text{s}, 1\text{H}),$ $10.73(\text{s}, 1\text{H})$

表-2 (つづき)

実施例 No.	構 造	^1H NMR
12		DMSO-d ₆ $\delta = 0.79(\text{t}, 3\text{H}), 1.59(\text{m}, 2\text{H}), 2.22(\text{s}, 5\text{H}), 2.82(\text{t}, 2\text{H}),$ $3.05-3.30(\text{m}, 4\text{H}), 3.50-3.85(\text{m}, 6\text{H}), 4.07(\text{t}, 2\text{H}), 6.86(\text{t}, 3\text{H}),$ $6.97(\text{d}, 2\text{H}), 7.10(\text{t}, 1\text{H}), 7.20-7.28(\text{m}, 2\text{H}), 7.47(\text{d}, 2\text{H}),$ $7.70-7.80(\text{m}, 4\text{H}), 8.43(\text{s}, 1\text{H}), 10.68(\text{s}, 1\text{H}), 10.82(\text{s}, 1\text{H})$
13		DMSO-d ₆ $\delta = 2.11(\text{s}, 3\text{H}), 2.22(\text{s}, 5\text{H}), 3.00-3.80(\text{m}, 10\text{H}), 4.07(\text{t}, 2\text{H}),$ $6.86(\text{t}, 3\text{H}), 6.97(\text{d}, 2\text{H}), 7.10(\text{t}, 1\text{H}), 7.24(\text{t}, 2\text{H}),$ $7.36(\text{d}, 1\text{H}), 7.55(\text{s}, 1\text{H}), 7.58(\text{s}, 1\text{H}), 7.88(\text{t}, 1\text{H}), 7.92(\text{t}, 1\text{H}), 8.40(\text{s}, 1\text{H}),$ $9.36(\text{s}, 1\text{H}), 10.43(\text{s}, 1\text{H}), 10.66(\text{s}, 1\text{H})$
14		DMSO-d ₆ $\delta = 0.92(\text{t}, 3\text{H}), 1.65-1.85(\text{m}, 2\text{H}), 2.21(\text{s}, 5\text{H}), 3.00-3.20(\text{m}, 10\text{H}),$ $3.40-3.80(\text{m}, 10\text{H}), 4.05(\text{t}, 2\text{H}), 6.80-7.00(\text{m}, 7\text{H}), 7.07(\text{t}, 1\text{H}),$ $7.25(\text{t}, 2\text{H}), 7.40(\text{d}, 2\text{H}), 8.05(\text{s}, 1\text{H}), 9.63(\text{s}, 1\text{H}), 10.59(\text{s}, 1\text{H}),$ $10.78(\text{s}, 1\text{H})$
15		DMSO-d ₆ $\delta = 1.31(\text{d}, 6\text{H}), 2.21(\text{s}, 5\text{H}), 3.00-3.20(\text{m}, 8\text{H}), 3.40-3.80(\text{m}, 11\text{H}),$ $4.06(\text{t}, 2\text{H}), 6.80-7.00(\text{m}, 7\text{H}), 7.07(\text{t}, 1\text{H}), 7.26(\text{t}, 2\text{H}),$ $7.41(\text{d}, 2\text{H}), 8.03(\text{s}, 1\text{H}), 9.61(\text{s}, 1\text{H}), 10.57(\text{s}, 1\text{H}), 10.67(\text{s}, 1\text{H})$

表-2 (つづき)

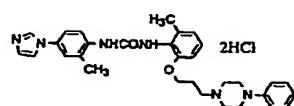
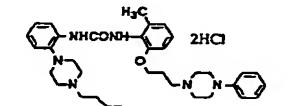
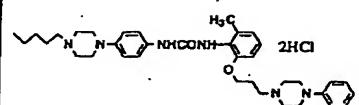
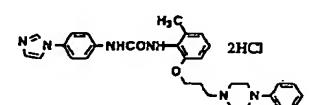
実施例 No.	構 造	¹ H NMR
16		DMSO-d ₆ $\delta = 2.23(s,5H), 2.45(s,3H), 3.00-3.25(m,4H), 3.40-3.80(m,6H), 4.07(t,2H), 6.80-7.00(m,5H), 7.10(t,1H), 7.21(t,2H), 7.54(dd,1H), 7.61(d,1H), 7.87(s,1H), 8.10-8.20(m,2H), 9.02(s,1H), 9.18(s,1H), 9.64(s,1H), 10.84(s,1H)$
17		DMSO-d ₆ $\delta = 0.89(t,3H), 1.20-1.40(m,2H), 1.60-1.80(m,2H), 2.21(s,5H), 3.00-3.80(m,20H), 4.06(t,3H), 6.80-7.00(m,6H), 7.00-7.20(m,3H), 7.25(t,2H), 8.19(d,2H), 8.80(s,1H), 9.36(s,1H), 10.56(s,1H), 10.65(s,1H)$
18		DMSO-d ₆ $\delta = 0.90(t,3H), 1.20-1.40(m,4H), 1.60-1.80(m,2H), 2.21(s,5H), 3.00-3.80(m,20H), 4.05(t,3H), 6.80-7.00(m,7H), 7.07(t,1H), 7.26(t,2H), 7.39(d,2H), 8.00(s,1H), 9.55(s,1H), 10.48(s,1H), 10.56(s,1H)$
19		DMSO-d ₆ $\delta = 2.22(s,5H), 3.00-3.25(m,4H), 3.40-3.80(m,6H), 4.08(t,2H), 6.80-7.00(m,5H), 7.09(t,1H), 7.23(t,2H), 7.70(q,4H), 7.88(t,1H), 8.19(s,1H), 8.41(s,1H), 9.66(t,1H), 10.59(s,1H), 10.84(s,1H)$

表-2 (つづき)

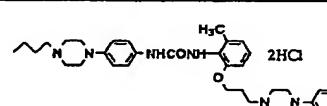
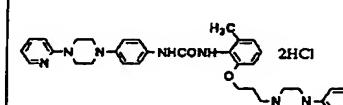
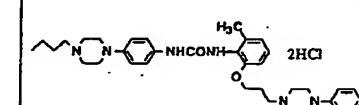
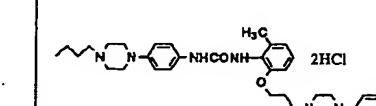
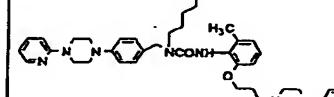
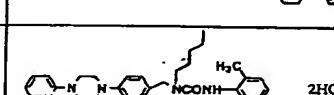
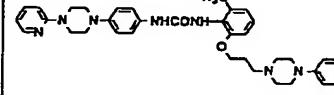
実施例 No.	構 造	¹ H NMR
20		DMSO-d ₆ $\delta = 0.92(t,3H), 1.20-1.40(m,2H), 1.60-1.80(m,2H), 2.21(s,5H), 3.00-3.70(m,20H), 3.80(s,3H), 4.05(t,3H), 6.80-7.10(m,9H), 7.40(d,2H), 8.06(s,1H), 9.62(s,1H), 10.53(s,1H), 10.83(s,1H)$
21		DMSO-d ₆ $\delta = 2.21(s,5H), 2.90-3.90(m,14H), 3.79(s,3H), 3.90(s,4H), 4.05(t,2H), 6.80-7.20(m,10H), 7.33(d,1H), 7.47(d,2H), 7.94(t,1H), 8.07(s,1H), 8.09(s,1H), 9.73(s,1H), 10.50(s,1H)$
22		DMSO-d ₆ $\delta = 0.92(t,3H), 1.20-1.40(m,2H), 1.60-1.80(m,2H), 2.21(s,5H), 3.00-3.70(m,20H), 4.05(t,3H), 6.80-7.15(m,9H), 7.40(d,2H), 8.04(s,1H), 9.61(s,1H), 10.54(s,1H), 10.69(s,1H)$
23		DMSO-d ₆ $\delta = 0.92(t,3H), 1.20-1.40(m,2H), 1.60-1.80(m,2H), 2.21(s,5H), 3.00-3.70(m,20H), 4.06(t,3H), 6.80-6.95(m,4H), 6.95-7.25(m,5H), 7.39(d,2H), 8.03(s,1H), 9.59(s,1H), 10.61(s,1H), 10.70(s,1H)$

表-2 (つづき)

実施例 No.	構 造	¹ H NMR
24		CDCl ₃ $\delta = 1.23(m,3H), 1.65-1.81(m,6H), 1.91(m,2H),$ $2.23(s,3H), 2.47-2.59(m,6H), 3.19(m,6H), 3.29(m,4H)$ $3.68(m,4H), 3.99(2H), 4.55(s,2H), 6.07(s,1H),$ $6.62-6.84(m,10H), 7.26(m,4H), 7.49(m,1H), 8.20(d,1H)$
25		DMSO-d ₆ $\delta = 1.15(m,3H), 1.67(m,4H), 2.07(s,3H), 2.14(m,4H),$ $3.05-3.70(m,13H), 3.89(m,4H), 4.07(2H), 4.48(s,2H)$ $6.80-7.45(m,15H), 8.04(m,2H), 11.35(bs,1H)$
26		CDCl ₃ $\delta = 1.98(m,2H), 2.34(t,3H), 2.54(m,6H), 3.14(m,4H),$ $3.22(m,4H), 3.68(m,4H), 4.05(t,2H), 6.04(s,1H), 6.37(s,1H),$ $6.67(m,2H), 6.79-6.93(m,7H), 7.14(t,1H),$ $7.21-7.29(m,4H), 7.49(t,1H), 8.22(d,1H),$
27		DMSO-d ₆ $\delta = 2.21(m,5H), 3.07(m,4H), 3.27(m,4H), 3.47-3.74(m,7H),$ $3.86(m,4H), 4.05(t,2H), 6.82-6.96(m,6H), 7.08(m,3H),$ $7.25(m,3H), 7.45(d,2H), 7.92-8.09(m,3H), 9.62(bs,1H),$ $10.44(bs,1H)$

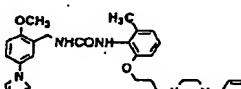
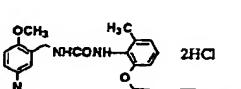
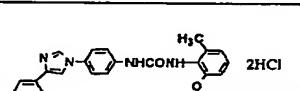
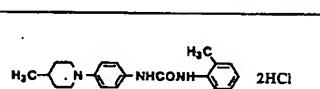
[0143]

[卷八]

[0144]

[表82]

實施例 N。 構造

実施例 No.	構 造	¹ H NMR
28		CDCl ₃ $\delta = 1.87(m,2H), 2.27(s,3H), 2.48(t,2H), 2.56(m,4H),$ $3.17(t,4H), 3.78(s,3H), 3.98(t,2H), 4.43(d,2H), 5.07(s,1H)$ $5.85(s,1H), 6.82-6.92(m,6H), 7.17-7.30(m,7H), 7.74(d,1H)$
29		DMSO-d ₆ $\delta = 2.14(m,5H), 3.43(m,11H), 3.89(s,3H), 4.02(t,2H),$ $4.33(d,2H), 6.78-6.86(m,3H), 6.96-7.01(m,3H),$ $7.21-7.28(m,4H), 7.66(m,1H), 7.85(d,2H),$ $7.96(s,1H), 8.21(s,1H), 9.59(s,1H), 10.72(bs,1H).$
30		DMSO-d ₆ $\delta = 2.23(s,5H), 3.00-3.80(m,10H), 4.06(t,2H), 6.80-7.00(m,5H),$ $7.05-7.30(m,3H), 7.74(s,4H), 7.94(d,2H), 8.35(d,1H)$ $9.57(s,1H), 10.44(s,1H), 10.62(s,1H),$
31		DMSO-d ₆ $\delta = 0.97(s,3H), 1.77(broad s,5H), 2.21(s,5H), 2.95-3.20(m,4H),$ $2.23(s,3H), 3.30-3.80(m,10H), 4.05(t,2H), 6.80-7.30(m,8H),$ $7.50-7.80(m,4H), 8.24(s,1H), 7.84(s,1H), 10.20(s,1H), 10.50(s,1H)$

[0145]

[283]

[0146]

[表8-4]

実施例 No.	構 造	^1H NMR
32		DMSO- d_6 $\delta = 0.91(\text{s},3\text{H}), 2.23(\text{s},5\text{H}), 2.71(\text{q},2\text{H}), 3.00\text{-}3.80(\text{m},10\text{H}),$ $6.80\text{-}7.30(\text{m},8\text{H}), 7.50\text{-}7.80(\text{m},9\text{H}), 8.41(\text{s},1\text{H}), 9.37(\text{s},1\text{H})$ $10.64(\text{s},2\text{H})$
33		CDCl_3 $\delta = 1.96(\text{quint},2\text{H}), 2.32(\text{t},3\text{H}), 2.40\text{-}2.60(\text{m},6\text{H}), 2.66(\text{t},4\text{H}),$ $3.71(\text{s},2\text{H}), 4.02(\text{t},2\text{H}), 6.22(\text{t},4\text{H}), 6.61(\text{s},1\text{H}), 6.70\text{-}7.00(\text{m},7\text{H}),$ $7.10\text{-}7.30(\text{m},6\text{H}), 7.43(\text{d},1\text{H}), 7.60\text{-}7.75(\text{m},1\text{H}), 8.58(\text{d},1\text{H})$
34		CDCl_3 $\delta = 2.00(\text{quint},2\text{H}), 2.12(\text{s},3\text{H}), 2.36(\text{s},3\text{H}), 2.50\text{-}2.70(\text{m},6\text{H}),$ $3.14(\text{t},4\text{H}), 4.07(\text{t},2\text{H}), 4.63(\text{s},2\text{H}), 6.43(\text{s},1\text{H}),$ $6.80\text{-}7.00(\text{m},5\text{H}), 7.10\text{-}7.28(\text{m},6\text{H}), 7.46\text{-}7.54(\text{m},3\text{H})$
35		DMSO- d_6 $\delta = 2.08(\text{s},3\text{H}), 2.23(\text{s},5\text{H}), 3.30\text{-}3.55(\text{m},10\text{H}), 4.07(\text{t},2\text{H}),$ $4.50(\text{s},2\text{H}), 4.55(\text{s},2\text{H}), 6.80\text{-}7.40(\text{m},15\text{H}), 7.68(\text{d},2\text{H})$ $8.25(\text{s},2\text{H}), 10.25(\text{s},1\text{H})$

にオレイン酸-レイン酸アラルミニウム複合体を添加し、 α -レステロールオリエートの量を測定することにより求められた。ACATを阻害する本発明の化合物の活性は、被膜形成能を加えない对照群のコレステロールオリエート生成能を基にして、各濃度 (μM) の被膜形成能を加えることによ

化合物 (実験No.)	ACAT阻害活性(CS ₅₀ μM)	
	Hep G2	マクロファージ
1	100	100

実施例 No.	構造	¹ H NMR
40		CDCl_3 $\delta = 0.91(\text{t}, 3\text{H}), 1.35(\text{m}, 4\text{H}), 1.73(\text{m}, 2\text{H}), 1.85(\text{m}, 2\text{H}),$ $2.25(\text{s}, 3\text{H}), 2.44(\text{s}, 2\text{H}), 2.59(\text{bs}, 2\text{H}), 3.07(\text{bs}, 4\text{H}), 3.40(\text{t}, 2\text{H})$ $3.86(\text{s}, 3\text{H}), 3.90(\text{s}, 3\text{H}), 3.98(\text{s}, 2\text{H}), 4.64(\text{s}, 2\text{H}), 6.19(\text{s}, 1\text{H})$ $6.73(\text{d}, 1\text{H}), 6.80-6.87(\text{m}, 2\text{H}), 6.93-7.02(\text{m}, 5\text{H}), 7.19(\text{d}, 1\text{H}),$ $7.27(\text{m}, 1\text{H}), 7.34(\text{d}, 1\text{H}), 7.77(\text{s}, 1\text{H})$
41		CDCl_3 $\delta = 0.89(\text{t}, 3\text{H}), 1.35(\text{m}, 4\text{H}), 1.74(\text{m}, 2\text{H}), 1.84(\text{m}, 2\text{H}),$ $2.25(\text{s}, 3\text{H}), 2.44(\text{s}, 2\text{H}), 2.55(\text{bs}, 4\text{H}), 3.08(\text{bs}, 4\text{H}), 3.40(\text{t}, 2\text{H})$ $3.90(\text{s}, 3\text{H}), 3.97(\text{s}, 2\text{H}), 4.64(\text{s}, 2\text{H}), 6.19(\text{s}, 1\text{H})$ $6.72(\text{d}, 1\text{H}), 6.81(\text{d}, 1\text{H}), 6.91-7.05(\text{m}, 6\text{H}), 7.19(\text{d}, 2\text{H}),$ $7.29(\text{m}, 1\text{H}), 7.35(\text{d}, 1\text{H}), 7.77(\text{s}, 1\text{H})$
42		CDCl_3 $\delta = 0.91(\text{t}, 3\text{H}), 1.35(\text{m}, 4\text{H}), 1.73(\text{m}, 2\text{H}), 1.83(\text{m}, 2\text{H}), 2.25(\text{s}, 3\text{H})$ $2.42(\text{d}, 2\text{H}), 2.53(\text{bs}, 4\text{H}), 3.09(\text{bs}, 4\text{H}), 3.40(\text{t}, 2\text{H}),$ $3.90(\text{s}, 3\text{H}), 3.97(\text{s}, 2\text{H}), 4.64(\text{s}, 2\text{H}), 6.18(\text{s}, 1\text{H}),$ $6.73(\text{d}, 1\text{H}), 6.84-7.02(\text{m}, 7\text{H}), 7.19(\text{d}, 2\text{H}), 7.26(\text{m}, 1\text{H}),$ $7.34(\text{d}, 1\text{H}), 7.77(\text{s}, 1\text{H})$

[0147] 対象例1：ヒト肝臓癌細胞HelaのLc pG

2細胞のACA-T阻害活性 40 のに必要な被膜化合物の濃度)を求めた。結果を下記表

本発明の化合物の λ CAT阻害作用を以下の方針により
3に示す。

[848] 説明2：泡沫化マクロファージのACV

本研究の化合物のマクロファージPACAT細胞作成を
試みたオレイン酸-ウシ血清アルブミン複合体を添加

し、細胞内に放射性オレイン酸から形成された放射性オレイン酸の量を測定した。

コレステロールオリエートの量を調定することにより採取したマクロファージにアセチル化低比重リボタン

フロントページの統一

[0150]【発明の効果】本発明の化合物は酵素ACATに対して強力な阻害作用を有しており、高脂血症、アテローム性動脈硬化症の予防、治療剤として有用である。

強力な細胞作用を有しており、高脂血症、アテローム性動脈硬化症の予防、治療剤として有用である。

フロントページの統一

(51) Int. Cl. 4

A B I K 31/505

C 07 D 213/30

213/71

213/74
991/12

233/61

233/84

239/42
249/08

277/36	277/36
295/12	A
	Z
307/64	307/64
333/34	333/34
401/12	401/12
211	211
231	231
233	233
239	239
403/12	403/12
231	231
233	233

(7) 発明者 篠木 一夫
神奈川県横浜市神奈川区鶴見町1000番地
三菱化学株式会社鶴見総合研究所内

(7) 発明者 高橋 千尋子
神奈川県横浜市神奈川区鶴見町1000番地
三菱化学株式会社鶴見総合研究所内

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- BLACK BORDERS**
- IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- FADED TEXT OR DRAWING**
- BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- SKEWED/SLANTED IMAGES**
- COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- GRAY SCALE DOCUMENTS**
- LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- OTHER: Side text**

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.